

**NOVEL SPHINGOGLYCOLIPID AND USE THEREOF.**

Patent Number: ☐ EP0609437, A4, B1  
Publication date: 1994-08-10  
Inventor(s): AKIMOTO KOJI KIRIN BEER K K (JP); HIGA TATSUO (JP); KOEZUKA YASUHIKO KIRIN BEER KA (JP); MORITA MASAHIRO KIRIN BEER KAB (JP); NATORI TAKENORI KIRIN BEER KAB (JP); SAKAI TERUYUKI KIRIN BEER KABU (JP)  
Applicant(s): KIRIN BREWERY (JP)  
Requested Patent: ☐ WO9305055  
Application Number: EP19920909489 19920428  
Priority Number (s): WO1992JP00561 19920428; JP19910244384 19910829  
IPC Classification: C07H15/10; C07H15/04; A61K37/20  
EC Classification: C07H15/10D2, C12P19/44  
Equivalents: AU1666492, AU665536, CA2116442, DE69229557D, DE69229557T, ES2134213T, ☐ FI105189B, FI940851, HK1009967, HU70435, ☐ JP5059081, KR220793, ☐ PT100736, SG44031, ZA9203239  
Cited Documents: EP0371414

**Abstract**

A novel sphingoglycolipid represented by general formula (A), wherein R represents -CH(R<sub>2</sub>)-(CH<sub>2</sub>)X-H or -(CH<sub>2</sub>)<sup>7</sup>CH=CH(CH<sub>2</sub>)<sup>7</sup>-CH<sub>3</sub>; R<sub>1</sub> represents -CH(R<sub>2</sub>)-(CH<sub>2</sub>)Y-R<sub>3</sub> or -CH=CH-(CH<sub>2</sub>)Y-CH<sub>3</sub>; R<sub>2</sub> represents H or OH; R<sub>3</sub> represents methyl, isopropyl or sec-butyl; X represents an integer of 0 to 26; and Y represents an integer of 5 to 17. An antineoplastic agent and an immunopotentiator containing at least one abovementioned compound as an active ingredient. A process for preparing a sphingoglycolipid by taking a specified sphingoglycolipid out of a sponge *Agelas mauritanus*.

Data supplied from the esp@cenet database - I2

第 86119711 號  
初審(訴願)引証附件 二  
再審 世界知的所有權機關

PCT

國際事務局

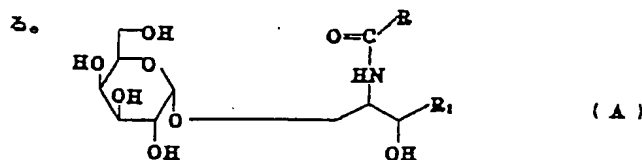


特許協力条約に基づいて公開された国際出願

<p>(51) 国際特許分類 5 C07H 15/10, 15/04, A61K 37/20</p>	<p>A1</p>	<p>(11) 国際公開番号 WO 93/05055</p> <p>(43) 国際公開日 1993年3月18日(18.03.1993)</p>
<p>(21) 国際出願番号 PCT/JP92/00561 (22) 国際出願日 1992年4月28日(28. 04. 92) (30) 優先権データ 特願平3/244384 1991年8月29日(29. 08. 91) JP (71) 出願人 麒麟麦酒株式会社 (KIRIN BEER KABUSHIKI KAISHA)(JP/JP) 〒150 東京都渋谷区神宮前6丁目2番1号 Tokyo, (JP) (72) 発明者 比嘉辰雄(HIGA, Tatsuo) 〒903 沖縄県那覇市首里石嶺町1-62-3 Okinawa, (JP) 秋元功司(AKIMOTO, Koji) 肥塚靖彦(KOEBZUKA, Yasuhiko) 酒井輝行(SAKAI, Teruyuki) 森田真弘(MORITA, Masahiro) 名取威徳(NATORI, Takenori) 〒370-12 群馬県高崎市宮原町3番地 麒麟麦酒株式会社 医薬開発研究所 Gunma, (JP) (74) 代理人 弁理士 佐藤一雄, 外(SATO, Kazuo et al.) 〒100 東京都千代田区丸の内三丁目2番3号 富士ビル323号 協和特許法律事務所 Tokyo, (JP)</p>		<p>(81) 指定国 AT(欧州特許), AU, BB, BE(欧州特許), BF(OAPI特許), BG, BJ(OAPI特許), BR, CA, CF(OAPI特許), GG(OAPI特許), CH(欧州特許), CI(OAPI特許), CM(OAPI特許), CS, DE(欧州特許), DK(欧州特許), ES(欧州特許), FI, FR(欧州特許), GA(OAPI特許), GB(欧州特許), GN(OAPI特許), GR(欧州特許), HU, IT(欧州特許), JP, KR, LK, LU(欧州特許), MC(欧州特許), MG, ML(OAPI特許), MN, MR(OAPI特許), MW, NL(欧州特許), NO, PL, RO, RU, SD, SE(欧州特許), SN(OAPI特許), TD(OAPI特許), TG(OAPI特許).</p> <p>添付公開書類 国際調査報告書</p>

(54) Title : NOVEL SPHINGOGLYCOLIPID AND USE THEREOF

(54) 発明の名称 新規スフィンゴ脂質およびその使用

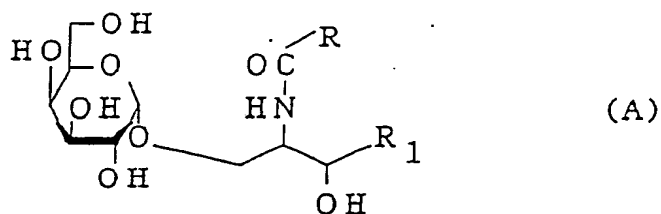


(57) Abstract

A novel sphingoglycolipid represented by general formula (A), wherein R represents  $-\text{CH}(\text{R}_2)(\text{CH}_2)_X-\text{H}$  or  $-(\text{CH}_2)_7\text{CH}=\text{CH}(\text{CH}_2)_7-\text{CH}_3$ ;  $\text{R}_1$  represents  $-\text{CH}(\text{R}_2)(\text{CH}_2)_Y-\text{R}_3$  or  $-\text{CH}=\text{CH}(\text{CH}_2)_Y-\text{CH}_3$ ;  $\text{R}_2$  represents H or OH;  $\text{R}_3$  represents methyl, isopropyl or sec-butyl; X represents an integer of 0 to 26; and Y represents an integer of 5 to 17. An antineoplastic agent and an immunopotentiator containing at least one abovementioned compound as an active ingredient. A process for preparing a sphingoglycolipid by taking a specified sphingoglycolipid out of a sponge *Agelas mauritanus*.

## 請 求 の 範 囲

1. 次式 (A) で示されるスフィンゴ糖脂質。



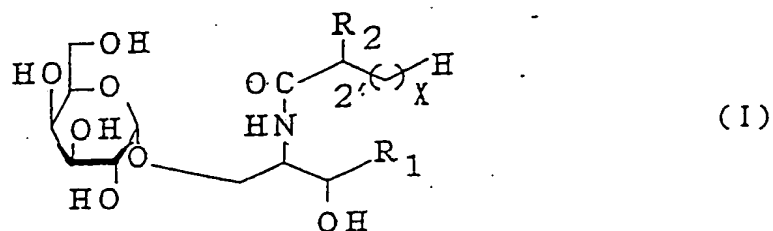
式中、R は  $\begin{array}{c} R \\ | \\ \text{---} \text{C} \text{---} \text{C} \text{---} \text{H} \\ | \quad | \\ \text{---} \quad \text{---} \end{array}$   $\text{R}_2$  (ここで、 $\text{R}_2$  は

H または OH を表わすし、X は 0 ~ 26 のいずれかの整数である) または

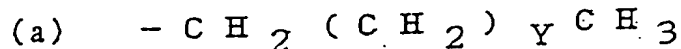
- (CH<sub>2</sub>)<sub>7</sub>CH=CH(CH<sub>2</sub>)<sub>7</sub>CH<sub>3</sub> を表わし、  
R<sub>1</sub> は下記 (a) ~ (e) で定義される置換基のいずれかである (ここで、Y は 5 ~ 17 のいずれかの整数である)。

- (a) -CH<sub>2</sub>(CH<sub>2</sub>)<sub>Y</sub>CH<sub>3</sub>
- (b) -CH(OH)(CH<sub>2</sub>)<sub>Y</sub>CH<sub>3</sub>
- (c) -CH(OH)(CH<sub>2</sub>)<sub>Y</sub>CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>
- (d) -CH=CH(CH<sub>2</sub>)<sub>Y</sub>CH<sub>3</sub>
- (e) -CH(OH)(CH<sub>2</sub>)<sub>Y</sub>CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>

2. 次式 (I) で示される、請求の範囲第 1 項記載のスフィンゴ糖脂質。

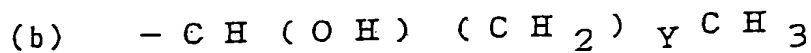


式中、 $R_1$  は下記 (a) ~ (e) で定義される置換基のいずれかであり、 $R_2$  は H または OH を表わす (X は下記 (a) ~ (e) 中で定義される)。



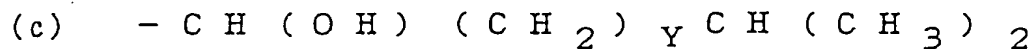
$R_2$  が H の場合、X は 0 ~ 24 のいずれか、Y は 7 ~ 15 のいずれかの整数であり、

$R_2$  が OH の場合、X は 20 ~ 24 のいずれか、Y は 11 ~ 15 のいずれかの整数である。



$R_2$  が H の場合、X は 18 ~ 26 のいずれか、Y は 5 ~ 15 のいずれかの整数であり、

$R_2$  が OH の場合、X は 18 ~ 26 のいずれか、Y は 5 ~ 17 のいずれかの整数である。

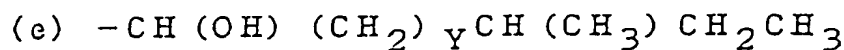


$R_2$  が H の場合、 $X$  は 20 ~ 24 のいずれか、 $Y$  は 9 ~ 13 のいずれかの整数であり、

$R_2$  が OH の場合、 $X$  は 18 ~ 24 のいずれか、 $Y$  は 9 ~ 13 のいずれかの整数である。

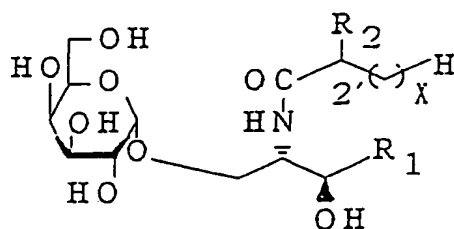


$R_2$  は H であり、 $X$  は 10 ~ 18 のいずれか、 $Y$  は 10 ~ 14 のいずれかの整数である。



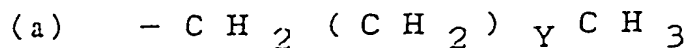
$R_2$  は OH であり、 $X$  は 21 ~ 25 のいずれか、 $Y$  は 9 ~ 13 のいずれかの整数である。

3. 次式 (II) で示される、請求の範囲第 2 項記載のスフィンゴ糖脂質。



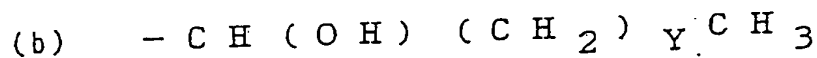
(II)

式中、 $R_1$  は下記 (a) ~ (e) で定義される置換基のいずれかであり、 $R_2$  は H または OH を表わす ( $X$  は下記 (a) ~ (e) 中で定義される)。



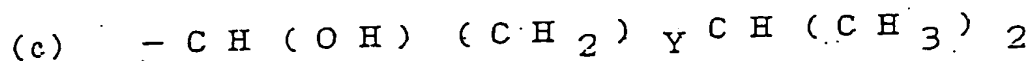
$R_2$  が H の場合、X は 0 ~ 24 のいずれか、Y は 7 ~ 15 のいずれかの整数であり、

$R_2$  が OH の場合、X は 20 ~ 24 のいずれか、Y は 11 ~ 15 のいずれかの整数である。



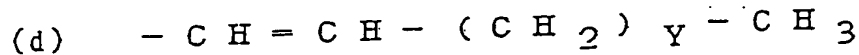
$R_2$  が H の場合、X は 18 ~ 26 のいずれか、Y は 5 ~ 15 のいずれかの整数であり、

$R_2$  が OH の場合、X は 18 ~ 26 のいずれか、Y は 5 ~ 17 のいずれかの整数である。

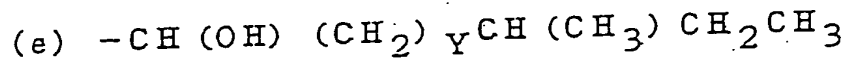


$R_2$  が H の場合、X は 20 ~ 24 のいずれか、Y は 9 ~ 13 のいずれかの整数であり、

$R_2$  が OH の場合、X は 18 ~ 24 のいずれか、Y は 9 ~ 13 のいずれかの整数である。

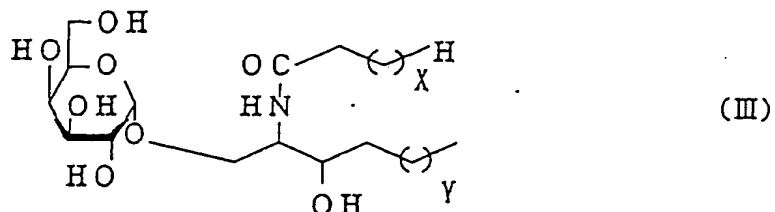


$R_2$  は H であり、X は 10 ~ 18 のいずれか、Y は 10 ~ 14 のいずれかの整数である。



$R_2$  は OH であり、X は 21 ~ 25 のいずれか、Y は 9 ~ 13 のいずれかの整数である。

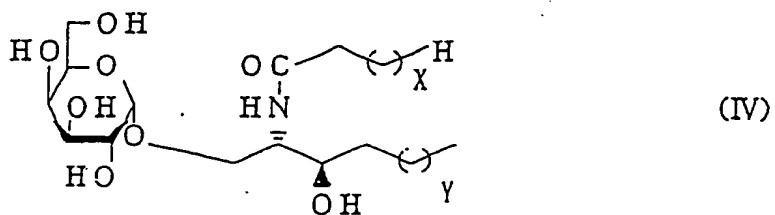
4. 次式 (Ⅲ) で示される、請求の範囲第 2 項記載のスフィンゴ糖脂質。



式中、X は 0 ~ 24 のいずれか、Y は 7 ~ 15 のいずれかの整数である。

5. X が 8 ~ 22 のいずれか、Y が 9 ~ 13 のいずれかの整数である、請求の範囲第 4 項記載のスフィンゴ糖脂質。

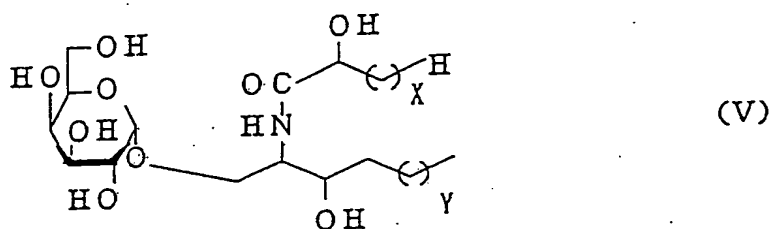
6. 次式 (Ⅳ) で示される、請求の範囲第 4 項記載のスフィンゴ糖脂質。



式中、X は 0 ~ 24 のいずれか、Y は 7 ~ 15 のいずれかの整数を表わす。

7. Xが8～22のいずれか、Yが9～13のいずれかの整数である、請求の範囲第6項記載のスフィンゴ糖脂質。

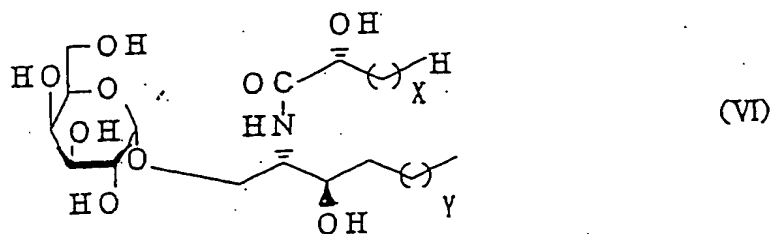
8. 次式(V)で示される、請求の範囲第2項記載のスフィンゴ糖脂質。



式中、Xは20～24のいずれか、Yは11～15のいずれかの整数である。

9. Xが21～23のいずれか、Yが12～14のいずれかの整数である、請求の範囲第8項記載のスフィンゴ糖脂質。

10. 次式(VI)で示される、請求の範囲第8項記載のスフィンゴ糖脂質。

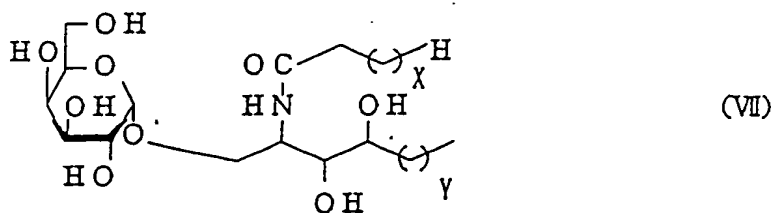




式中、Xは20～24のいずれか、Yは11～15のいずれかの整数である。

11. Xが21～23のいずれか、Yは12～14のいずれかの整数である、請求の範囲第10項記載のスフィンゴ糖脂質。

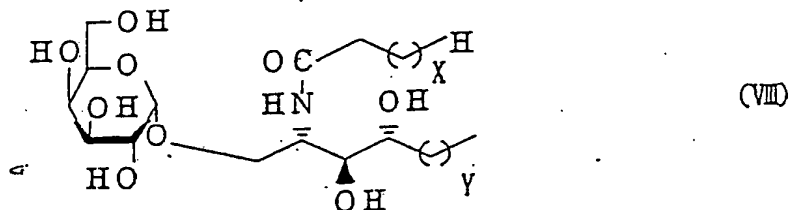
12. 次式(VII)で示される、請求の範囲第2項記載のスフィンゴ糖脂質。



式中、Xは18～26のいずれか、Yは5～15のいずれかの整数である。

13. Xが21～25のいずれか、Yが6～14のいずれかの整数である、請求の範囲第12項記載のスフィンゴ糖脂質。

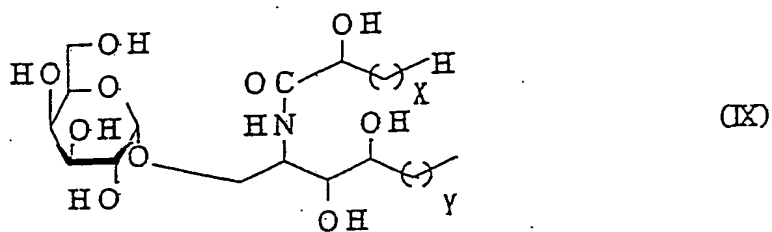
14. 次式(VIII)で示される、請求の範囲第12項記載のスフィンゴ糖脂質。



式中、Xは18～26のいずれか、Yは5～15のいずれかの整数である。

15. Xが21～25のいずれか、Yが6～14のいずれかの整数である、請求の範囲第14項記載のスフィンゴ糖脂質。

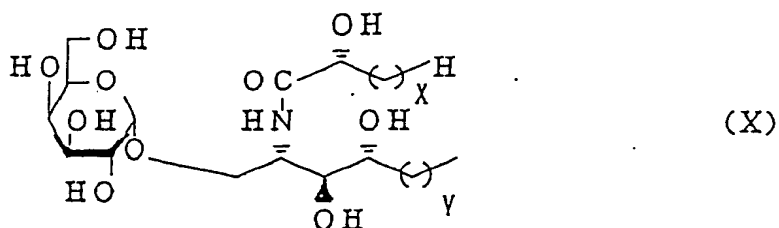
16. 次式 (IX) で示される、請求の範囲第2項記載のスフィンゴ糖脂質。



式中、Xは18～26のいずれか、Yは5～17のいずれかの整数である。

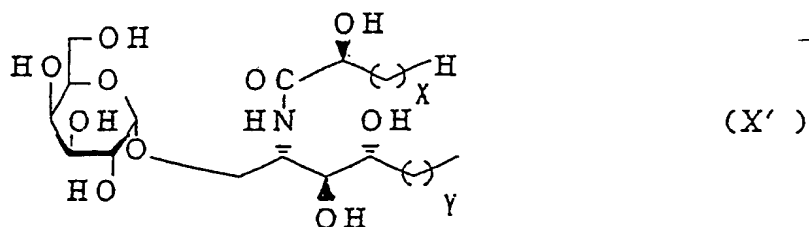
17. Xが21～25のいずれか、Yが6～16のいずれかの整数である、請求の範囲第16項記載のスフィンゴ糖脂質。

18. 次式 (X) で示される、請求の範囲第16項記載のスフィンゴ糖脂質。



式中、Xは18～26のいずれか、Yは5～17のいずれかの整数である。

19. 次式 (X') で示される、請求の範囲第16項記載のスフィンゴ糖脂質。

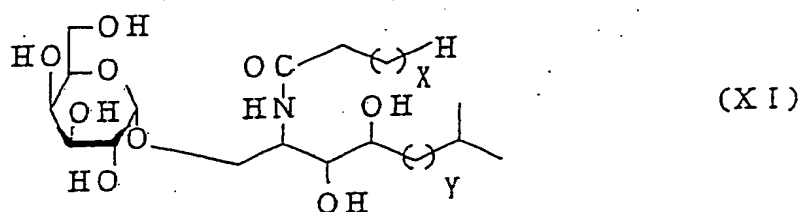


式中、Xは20～24のいずれか、Yは10～14のいずれかの整数である。

20. Xが21～25のいずれか、Yが6～16のいずれかの整数である、請求の範囲第18項記載のスフィンゴ糖脂質。

21. Xが21～23のいずれか、Yが11～13のいずれかの整数である、請求の範囲第19項記載のスフィンゴ糖脂質。

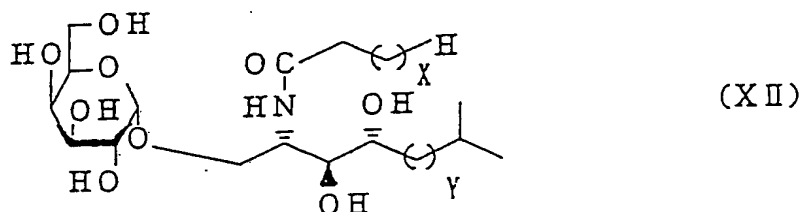
22. 次式(XI)で示される、請求の範囲第2項記載のスフィンゴ糖脂質。



式中、Xは20～24のいずれか、Yは9～13のいずれかの整数である。

23. Xが21～23のいずれか、Yが10～12のいずれかの整数である、請求の範囲第22項記載のスフィンゴ糖脂質。

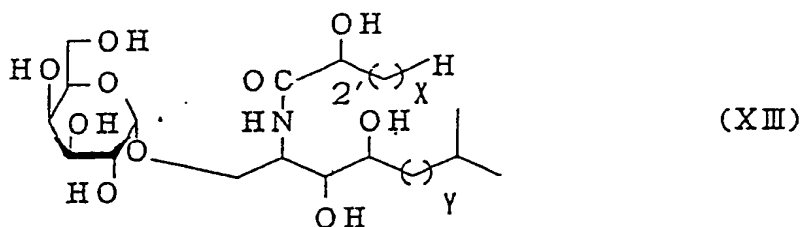
24. 次式(XII)で示される、請求の範囲第22項記載のスフィンゴ糖脂質。



式中、Xは20～24のいずれか、Yは9～13のいずれかの整数である。

25. Xが21～23のいずれか、Yが10～12のいずれかの整数である、請求の範囲第24項記載のスフィンゴ糖脂質。

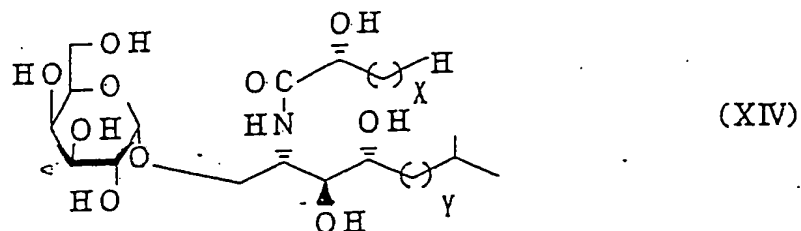
26. 次式(XIII)で示される、請求の範囲第2項記載のスフィンゴ糖脂質。



式中、Xは18～24のいずれか、Yは9～13のいずれかの整数である。

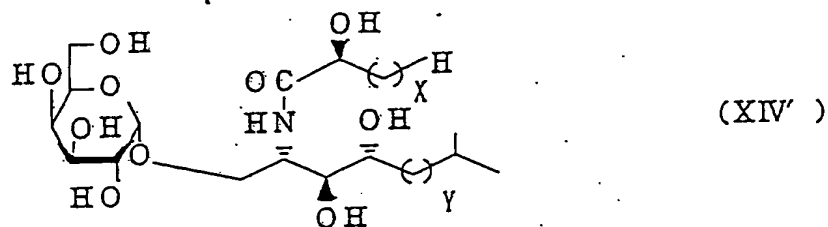
27. Xが20～23のいずれか、Yが10～12のいずれかの整数である、請求の範囲第26項記載のスフィンゴ糖脂質。

28. 次式(XIV)で示される、請求の範囲第26項記載のスフィンゴ糖脂質。



式中、Xは19～23のいずれか、Yは9～13のいずれかの整数である。

29. 次式(XIV')で示される、請求の範囲第26項記載のスフィンゴ糖脂質。



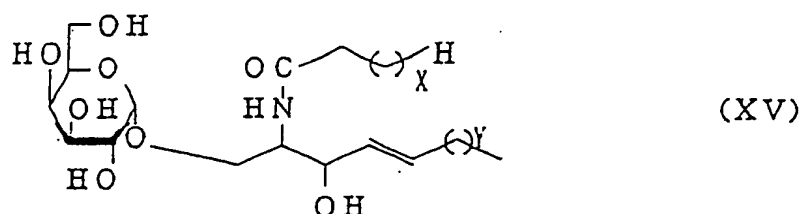
式中、Xは20～24のいずれか、Yは9～13のいずれかの整数である。

30. Xが20～22のいずれか、Yが10～12のいずれかの整数である、請求の範囲第28項記載のスフィンゴ糖脂質。

31. Xが21～23のいずれか、Yが10～12

のいずれかの整数である、請求の範囲第 29 項記載のスフィンゴ糖脂質。

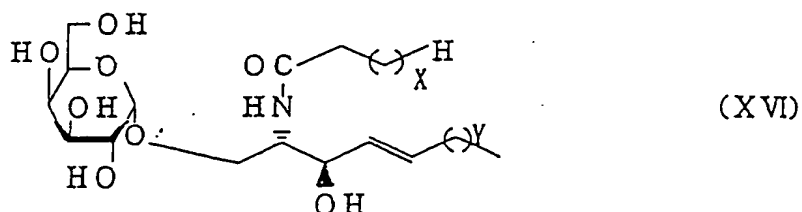
32. 次式 (XV) で示される、請求の範囲第 2 項記載のスフィンゴ糖脂質。



式中、X は 10 ~ 18 のいずれか、Y は 10 ~ 14 のいずれかの整数である。

33. X が 11 ~ 17 のいずれか、Y が 11 ~ 13 のいずれかの整数である、請求の範囲第 32 項記載のスフィンゴ糖脂質。

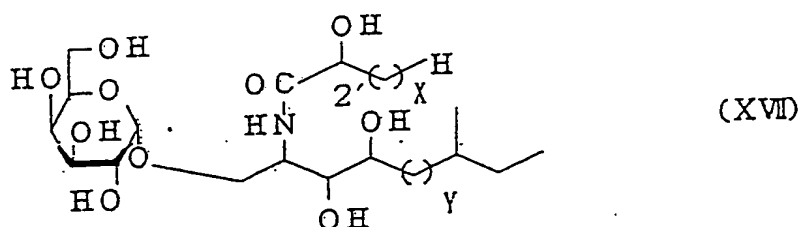
34. 次式 (XVI) で示される、請求の範囲第 32 項記載のスフィンゴ糖脂質。



式中、Xは10～18のいずれか、Yは10～14のいずれかの整数である。

35.. Xが11～17のいずれか、Yが11～13のいずれかの整数である、請求の範囲第34項記載のスフィンゴ糖脂質。

36. 次式(XVII)で示される、請求の範囲第2項記載のスフィンゴ糖脂質。

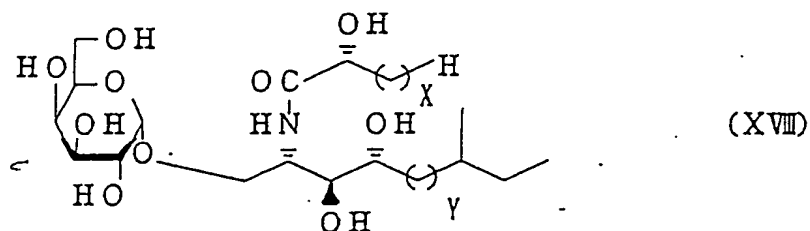


式中、Xは21～25のいずれか、Yは9～13のいずれかの整数である。

37. Xが22～24のいずれか、Yが10～12のいずれかの整数である、請求の範囲第36項記載のスフィンゴ糖脂質。

38. 次式(XVIII)で示される、請求の範囲第36項記載のスフィンゴ糖脂質。

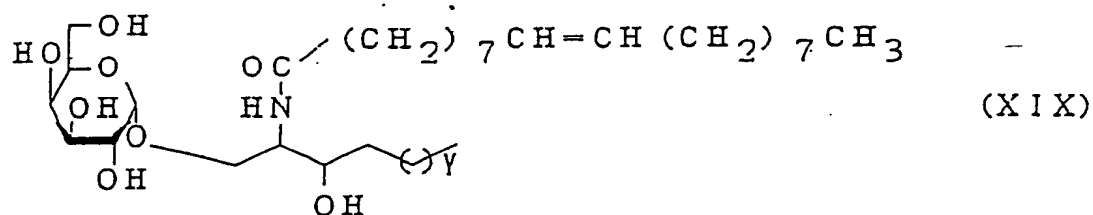




式中、Xは21～25のいずれか、Yは9～13のいずれかの整数である。

39. Xが22～24のいずれか、Yが10～12のいずれかの整数である、請求の範囲第38項記載のスフィンゴ糖脂質。

40. 次式(XIX)で示される、請求の範囲第1項記載のスフィンゴ糖脂質。

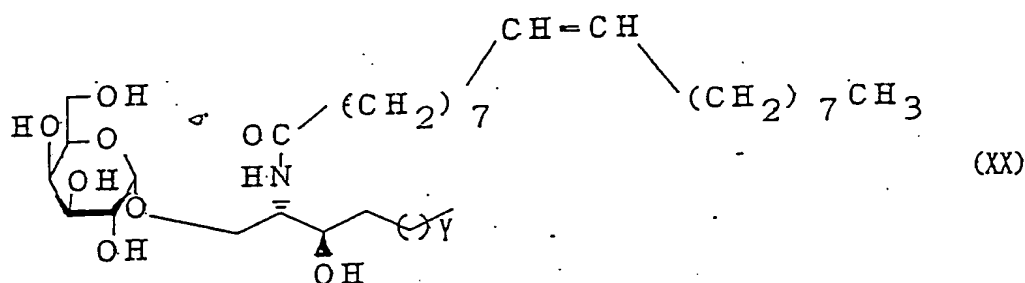


式中、Yは11～15のいずれかの整数である。

41. Yが12～14のいずれかの整数である、請求の範囲第40項記載のスフィンゴ糖脂質。

42. 次式(XX)で示される、請求の範囲第40項

記載のスフィンゴ糖脂質。



式中、Yは11～15のいずれかの整数である。

43. Yが12～14のいずれかの整数である、請求の範囲第42項記載のスフィンゴ糖脂質。

44. 下記の化合物からなる群から選ばれる、請求の範囲第1項記載のスフィンゴ糖脂質。

(1) (2S, 3R) - 1 - (α-D-ガラクトピラノシルオキシ) - 2 - テトラコサノイルアミノ - 3 - オクタデカノール、

(2) (2S, 3R) - 2 - ドコサノイルアミノ - 1 - (α-D-ガラクトピラノシルオキシ) - 3 - オクタデカノール、

(3) (2S, 3R) - 1 - (α-D-ガラクトピラノシルオキシ) - 2 - イコサノイルアミノ - 3 - オクタデカノール、

(4) (2S, 3R) - 1 - (α-D-ガラクトピラノシルオキシ) - 2 - オクタデカノイルアミノ - 3 - オクタデカノール、

(5) (2 S, 3 R) - 1 - ( $\alpha$  - D - ガラクトピ  
ラノシルオキシ) - 2 - テトラデカノイルアミノ - 3 -  
オクタデカノール、

(6) (2 S, 3 R) - 2 - デカノイルアミノ - 1  
- ( $\alpha$  - D - ガラクトピラノシルオキシ) - 3 - オクタ  
デカノール、

(7) (2 S, 3 R) - 1 - ( $\alpha$  - D - ガラクトピ  
ラノシルオキシ) - 2 - オクタノイルアミノ - 3 - オク  
タデカノール、

(8) (2 S, 3 R) - 2 - アセトアミノ - 1 -  
( $\alpha$  - D - ガラクトピラノシルオキシ) - 3 - オクタデ  
カノール、

(9) (2 S, 3 R) - 1 - ( $\alpha$  - D - ガラクトピ  
ラノシルオキシ) - 2 - テトラコサノイルアミノ - 3 -  
テトラデカノール、

(10) (2 S, 3 R) - 1 - ( $\alpha$  - D - ガラクトピ  
ラノシルオキシ) - 2 - テトラデカノイルアミノ - 3 -  
ヘキサデカノール、

(11) (2 R, 3 S) - 1 - ( $\alpha$  - D - ガラクトピ  
ラノシルオキシ) - 2 - テトラデカノイルアミノ - 3 -  
ヘキサデカノール、

(12) (2 S, 3 S) - 1 - ( $\alpha$  - D - ガラクトピ  
ラノシルオキシ) - 2 - テトラデカノイルアミノ - 3 -  
ヘキサデカノール、

(13) (2R, 3R) - 1 - ( $\alpha$ -D-ガラクトピ  
ラノシルオキシ) - 2 - テトラデカノイルアミノ - 3 -  
ヘキサデカノール、

(14) (2S, 3R) - 1 - ( $\alpha$ -D-ガラクトピ  
ラノシルオキシ) - 2 - [(R) - 2 - ヒドロキシテト  
ラコサノイルアミノ] - 3 - オクタデカノール、

(15) (2S, 3R, 4E) - 1 - ( $\alpha$ -D-ガラ  
クトピラノシルオキシ) - 2 - オクタデカノイルアミノ  
- 4 - オクタデセン - 3 - オール、

(16) (2S, 3R, 4E) - 1 - ( $\alpha$ -D-ガラ  
クトピラノシルオキシ) - 2 - テトラデカノイルアミノ  
- 4 - オクタデセン - 3 - オール、

(17) (2S, 3S, 4R) - 1 - ( $\alpha$ -D-ガラ  
クトピラノシルオキシ) - 2 - テトラコサノイルアミノ  
- 3, 4 - オクタデカンジオール、

(18) (2S, 3S, 4R) - 1 - ( $\alpha$ -D-ガラ  
クトピラノシルオキシ) - 2 - テトラコサノイルアミノ  
- 3, 4 - ヘプタデカンジオール、

(19) (2S, 3S, 4R) - 1 - ( $\alpha$ -D-ガラ  
クトピラノシルオキシ) - 2 - テトラコサノイルアミノ  
- 3, 4 - ペンタデカンジオール、

(20) (2S, 3S, 4R) - 1 - ( $\alpha$ -D-ガラ  
クトピラノシルオキシ) - 2 - テトラコサノイルアミノ  
- 3, 4 - ウンデカンジオール、

(21) (2S, 3S, 4R) - 1 - ( $\alpha$ -D-ガラクトピラノシルオキシ) - 2 - ヘキサコサノイルアミノ - 3, 4 - ヘプタデカンジオール、

(22) (2S, 3S, 4R) - 1 - ( $\alpha$ -D-ガラクトピラノシルオキシ) - 2 - [(R) - 2 - ヒドロキシテトラコサノイルアミノ] - 3, 4 - オクタデカンジオール、

(23) (2S, 3S, 4R) - 1 - ( $\alpha$ -D-ガラクトピラノシルオキシ) - 2 - [(R) - 2 - ヒドロキシテトラコサノイルアミノ] - 3, 4 - ヘプタデカンジオール、

(24) (2S, 3S, 4R) - 1 - ( $\alpha$ -D-ガラクトピラノシルオキシ) - 2 - [(R) - 2 - ヒドロキシテトラコサノイルアミノ] - 3, 4 - ペンタデカンジオール、

(25) (2S, 3S, 4R) - 1 - ( $\alpha$ -D-ガラクトピラノシルオキシ) - 2 - [(R) - 2 - ヒドロキシテトラコサノイルアミノ] - 3, 4 - ウンデカンジオール、

(26) (2S, 3S, 4R) - 1 - ( $\alpha$ -D-ガラクトピラノシルオキシ) - 2 - [(R) - 2 - ヒドロキシヘキサコサノイルアミノ] - 3, 4 - オクタデカンジオール、

(27) (2S, 3S, 4R) - 1 - ( $\alpha$ -D-ガラ

クトピラノシルオキシ) - 2 - [(R) - 2 - ヒドロキシヘキサコサノイルアミノ] - 3, 4 - ノナデカンジオール、

(28) (2S, 3S, 4R) - 1 - ( $\alpha$  - D - ガラクトピラノシルオキシ) - 2 - [(R) - 2 - ヒドロキシヘキサコサノイルアミノ] - 3, 4 - イコサンジオール、

(29) (2S, 3S, 4R) - 1 - ( $\alpha$  - D - ガラクトピラノシルオキシ) - 2 - [(S) - 2 - ヒドロキシテトラコサノイルアミノ] - 3, 4 - ヘプタデカンジオール、

(30) (2S, 3S, 4R) - 1 - ( $\alpha$  - D - ガラクトピラノシルオキシ) - 2 - [(R) - 2 - ヒドロキシテトラコサノイルアミノ] - 3, 4 - ヘキサデカンジオール、

(31) (2S, 3S, 4R) - 1 - ( $\alpha$  - D - ガラクトピラノシルオキシ) - 2 - [(S) - 2 - ヒドロキシテトラコサノイルアミノ] - 16 - メチル - 3, 4 - ヘプタデカンジオール、

(32) (2S, 3S, 4R) - 1 - ( $\alpha$  - D - ガラクトピラノシルオキシ) - 16 - メチル - 2 - テトラコサノイルアミノ - 3, 4 - ヘプタデカンジオール、

(33) (2S, 3S, 4R) - 1 - ( $\alpha$  - D - ガラクトピラノシルオキシ) - 2 - [(R) - 2 - ヒドロキシ

シトリコサノイルアミノ] - 16 - メチル - 3, 4 - ヘ  
プタデカンジオール、

(34) (2S, 3S, 4R) - 1 - ( $\alpha$  - D - ガラ  
クトピラノシルオキシ) - 2 - [(R) - 2 - ヒドロキ  
シペンタコサノイルアミノ] - 16 - メチル - 3, 4 -  
オクタデカンジオール、

(35) (2S, 3R) - 1 - ( $\alpha$  - D - ガラクトピ  
ラノシルオキシ) - 2 - オレオイルアミノ - 3 - オクタ  
デカノール。

45. 下記の化合物からなる群から選ばれる、請求  
の範囲第44項記載のスフィンゴ糖脂質。

(1) (2S, 3R) - 1 - ( $\alpha$  - D - ガラクトピ  
ラノシルオキシ) - 2 - テトラコサノイルアミノ - 3 -  
オクタデカノール、

(2) (2S, 3R) - 2 - ドコサノイルアミノ -  
1 - ( $\alpha$  - D - ガラクトピラノシルオキシ) - 3 - オク  
タデカノール、

(3) (2S, 3R) - 1 - ( $\alpha$  - D - ガラクトピ  
ラノシルオキシ) - 2 - イコサノイルアミノ - 3 - オク  
タデカノール、

(4) (2S, 3R) - 1 - ( $\alpha$  - D - ガラクトピ  
ラノシルオキシ) - 2 - オクタデカノイルアミノ - 3 -  
オクタデカノール、

(5) (2S, 3R) - 1 - ( $\alpha$  - D - ガラクトピ

ラノシルオキシ) - 2 - テトラデカノイルアミノ - 3 -  
オクタデカノール、

(6) (2S, 3R) - 2 - デカノイルアミノ - 1  
- ( $\alpha$  - D<sup>G</sup> - ガラクトピラノシルオキシ) - 3 - オクタ  
デカノール、

(7) (2S, 3R) - 1 - ( $\alpha$  - D - ガラクトピ  
ラノシルオキシ) - 2 - オクタノイルアミノ - 3 - オク  
タデカノール、

(8) (2S, 3R) - 2 - アセトアミノ - 1 -  
( $\alpha$  - D - ガラクトピラノシルオキシ) - 3 - オクタデ  
カノール、

(9) (2S, 3R) - 1 - ( $\alpha$  - D - ガラクトピ  
ラノシルオキシ) - 2 - テトラコサノイルアミノ - 3 -  
テトラデカノール、

(10) (2S, 3R) - 1 - ( $\alpha$  - D - ガラクトピ  
ラノシルオキシ) - 2 - テトラデカノイルアミノ - 3 -  
ヘキサデカノール。

46. 下記の化合物からなる群から選ばれる、請求  
の範囲第45項記載のスフィンゴ糖脂質。

(1) (2S, 3R) - 1 - ( $\alpha$  - D - ガラクトピ  
ラノシルオキシ) - 2 - テトラコサノイルアミノ - 3 -  
オクタデカノール、

(2) (2S, 3R) - 2 - ドコサノイルアミノ -  
1 - ( $\alpha$  - D - ガラクトピラノシルオキシ) - 3 - オク



タデカノール、

(3) (2S, 3R) - 1 - ( $\alpha$ -D-ガラクトピ  
ラノシルオキシ) - 2 - イコサノイルアミノ - 3 - オク  
タデカノール、

(4) (2S, 3R) - 1 - ( $\alpha$ -D-ガラクトピ  
ラノシルオキシ) - 2 - オクタデカノイルアミノ - 3 -  
オクタデカノール、

(5) (2S, 3R) - 1 - ( $\alpha$ -D-ガラクトピ  
ラノシルオキシ) - 2 - テトラデカノイルアミノ - 3 -  
オクタデカノール、

(6) (2S, 3R) - 2 - デカノイルアミノ - 1  
- ( $\alpha$ -D-ガラクトピラノシルオキシ) - 3 - オクタ  
デカノール、

(7) (2S, 3R) - 1 - ( $\alpha$ -D-ガラクトピ  
ラノシルオキシ) - 2 - テトラコサノイルアミノ - 3 -  
テトラデカノール、

(8) (2S, 3R) - 1 - ( $\alpha$ -D-ガラクトピラ  
ノシルオキシ) - 2 - テトラデカノイルアミノ - 3 - ヘ  
キサデカノール。

47. 下記の化合物からなる群から選ばれる、請求  
の範囲第46項記載のスフィンゴ糖脂質。

(1) (2S, 3R) - 1 - ( $\alpha$ -D-ガラクトピ  
ラノシルオキシ) - 2 - オクタデカノイルアミノ - 3 -  
オクタデカノール、

(2) (2S, 3R) - 1 - ( $\alpha$  - D - ガラクトピ  
ラノシルオキシ) - 2 - テトラデカノイルアミノ - 3 -  
オクタデカノール、

(3) (2S, 3R) - 1 - ( $\alpha$  - D - ガラクトピラ  
ノシルオキシ) - 2 - テトラデカノイルアミノ - 3 - ヘ  
キサデカノール。

48. (2S, 3R) - 1 - ( $\alpha$  - D - ガラクトピ  
ラノシルオキシ) - 2 - [(R) - 2 - ヒドロキシテト  
ラコサノイルアミノ] - 3 - オクタデカノールである、  
請求の範囲第44項記載のスフィンゴ糖脂質。

49. 下記の化合物から選ばれる、請求の範囲第  
44項記載のスフィンゴ糖脂質。

(1) (2S, 3R, 4E) - 1 - ( $\alpha$  - D - ガラク  
トピラノシルオキシ) - 2 - オクタデカノイルアミノ -  
4 - オクタデセン - 3 - オール、

(2) (2S, 3R, 4E) - 1 - ( $\alpha$  - D - ガラク  
トピラノシルオキシ) - 2 - テトラデカノイルアミノ -  
4 - オクタデセン - 3 - オール。

50. 下記の化合物からなる群から選ばれる、請求  
の範囲第44項記載のスフィンゴ糖脂質。

(1) (2S, 3S, 4R) - 1 - ( $\alpha$  - D - ガラク  
トピラノシルオキシ) - 2 - テトラコサノイルアミノ -  
3, 4 - オクタデカンジオール、

(2) (2S, 3S, 4R) - 1 - ( $\alpha$  - D - ガラク

トピラノシルオキシ) - 2 - テトラコサノイルアミノ -  
3, 4 - ヘプタデカンジオール、

(3) (2 S, 3 S, 4 R) - 1 - (α - D - ガラク  
トピラノジルオキシ) - 2 - テトラコサノイルアミノ -  
3, 4 - ペンタデカンジオール、

(4) (2 S, 3 S, 4 R) - 1 - (α - D - ガラク  
トピラノシルオキシ) - 2 - テトラコサノイルアミノ -  
3, 4 - ウンデカンジオール、

(5) (2 S, 3 S, 4 R) - 1 - (α - D - ガラク  
トピラノシルオキシ) - 2 - ヘキサコサノイルアミノ -  
3, 4 - ヘプタデカンジオール。

51. 下記の化合物からなる群から選ばれる、請求  
の範囲第44項記載のスフィンゴ糖脂質。

(1) (2 S, 3 S, 4 R) - 1 - (α - D - ガラク  
トピラノシルオキシ) - 2 - [(R) - 2 - ヒドロキシ  
テトラコサノイルアミノ] - 3, 4 - オクタデカンジオ  
ール、

(2) (2 S, 3 S, 4 R) - 1 - (α - D - ガラク  
トピラノシルオキシ) - 2 - [(R) - 2 - ヒドロキシ  
テトラコサノイルアミノ] - 3, 4 - ヘプタデカンジオ  
ール、

(3) (2 S, 3 S, 4 R) - 1 - (α - D - ガラク  
トピラノシルオキシ) - 2 - [(R) - 2 - ヒドロキシ  
テトラコサノイルアミノ] - 3, 4 - ペンタデカンジオ

ール、

(4) (2 S, 3 S, 4 R) - 1 - ( $\alpha$  - D - ガラク  
トピラノシルオキシ) - 2 - [(R) - 2 - ヒドロキシ  
テトラコサノイルアミノ] - 3, 4 - ウンデカンジオー  
ル、

(5) (2 S, 3 S, 4 R) - 1 - ( $\alpha$  - D - ガラク  
トピラノシルオキシ) - 2 - [(R) - 2 - ヒドロキシ  
ヘキサコサノイルアミノ] - 3, 4 - オクタデカンジオ  
ール、

(6) (2 S, 3 S, 4 R) - 1 - ( $\alpha$  - D - ガラク  
トピラノシルオキシ) - 2 - [(R) - 2 - ヒドロキシ  
ヘキサコサノイルアミノ] - 3, 4 - ノナデカンジオー  
ル、

(7) (2 S, 3 S, 4 R) - 1 - ( $\alpha$  - D - ガラク  
トピラノシルオキシ) - 2 - [(R) - 2 - ヒドロキシ  
ヘキサコサノイルアミノ] - 3, 4 - イコサンジオール、

(8) (2 S, 3 S, 4 R) - 1 - ( $\alpha$  - D - ガラク  
トピラノシルオキシ) - 2 - [(S) - 2 - ヒドロキシ  
テトラコサノイルアミノ] - 3, 4 - ヘプタデカンジオ  
ール、

(9) (2 S, 3 S, 4 R) - 1 - ( $\alpha$  - D - ガラク  
トピラノシルオキシ) - 2 - [(R) - 2 - ヒドロキシ  
テトラコサノイルアミノ] - 3, 4 - ヘキサデカンジオ  
ール。

52. 下記の化合物からなる群から選ばれる、請求の範囲第44項記載のスフィンゴ糖脂質。

(1) (2S, 3S, 4R) - 1 - ( $\alpha$  - D - ガラクトピラノジルオキシ) - 2 - [(S) - 2 - ヒドロキシテトラコサノイルアミノ] - 16 - メチル - 3, 4 - ヘプタデカンジオール、

(2) (2S, 3S, 4R) - 1 - ( $\alpha$  - D - ガラクトピラノシルオキシ) - 16 - メチル - 2 - テトラコサノイルアミノ - 3, 4 - ヘプタデカンジオール、

(3) (2S, 3S, 4R) - 1 - ( $\alpha$  - D - ガラクトピラノシルオキシ) - 2 - [(R) - 2 - ヒドロキシトリコサノイルアミノ] - 16 - メチル - 3, 4 - ヘプタデカンジオール。

53. (2S, 3S, 4R) - 1 - ( $\alpha$  - D - ガラクトピラノシルオキシ) - 2 - [(R) - 2 - ヒドロキシペンタコサノイルアミノ] - 16 - メチル - 3, 4 - オクタデカンジオールである、請求の範囲第44項記載のスフィンゴ糖脂質。

54. (2S, 3R) - 1 - ( $\alpha$  - D - ガラクトピラノシルオキシ) - 2 - オレオイルアミノ - 3 - オクタデカノールである、請求の範囲第44項記載のスフィンゴ糖脂質。

55. 海綿動物アゲラス・マウリティアヌスを採取してこれを有機溶媒による抽出操作に付し、その抽出物

から請求の範囲第2項に記載の式(I)で示される下記の少なくとも1種のスフィンゴ糖脂質を採取することを特徴とする、スフィンゴ糖脂質の製造法。

(1) (2S, 3S, 4R) - 1 - ( $\alpha$  - D - ガラクトピラノシルオキシ) - 2 - [(R) - 2 - ヒドロキシテトラコサノイルアミノ] - 3, 4 - ヘプタデカンジオール、

(2) (2S, 3S, 4R) - 1 - ( $\alpha$  - D - ガラクトピラノシルオキシ) - 2 - [(R) - 2 - ヒドロキシテトラコサノイルアミノ] - 3, 4 - ヘキサデカンジオール、

(3) (2S, 3S, 4R) - 1 - ( $\alpha$  - D - ガラクトピラノシルオキシ) - 2 - [(R) - 2 - ヒドロキシトリコサノイルアミノ] - 16 - メチル - 3, 4 - ヘプタデカンジオール、

(4) (2S, 3S, 4R) - 1 - ( $\alpha$  - D - ガラクトピラノシルオキシ) - 2 - [(R) - 2 - ヒドロキシペンタコサノイルアミノ] - 16 - メチル - 3, 4 - オクタデカンジオール。

56. 請求の範囲第1項記載の化合物の1種または2種以上を有効成分として含有する抗腫瘍剤。

57. 請求の範囲第1項記載の化合物の1種または2種以上を有効成分として含有する免疫賦活剤。

58. 請求の範囲第1項記載の化合物の1種または

2種以上の有効量および担体または希釈剤を含有する抗腫瘍剤。

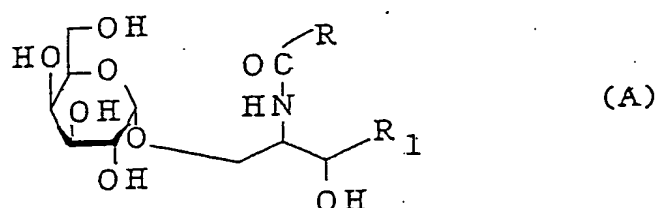
59. 請求の範囲第1項記載の化合物の1種または2種以上の有効量および担体または希釈剤を含有する免疫賦活剤。

60. 請求の範囲第1項記載の化合物の1種または2種以上の有効量を、腫瘍抑制を必要とする患者に投与することを特徴とする、腫瘍抑制方法。

61. 請求の範囲第1項記載の化合物の1種または2種以上の有効量を、免疫賦活を必要とする患者に投与することを特徴とする、免疫賦活方法。

## 要 約 書

本発明は、次式 (A) で示される新規なスフィンゴ糖脂質に関する。



式中、R は  $\begin{array}{c} R \\ | \\ \text{---} \text{C} \text{---} \text{C} \text{---} \text{H} \\ | \quad | \\ \quad \quad X \end{array}$  (ここで、R<sub>2</sub> は H ま

たは OH を表わし、X は 0 ~ 26 のいずれかの整数である) または

- (CH<sub>2</sub>)<sub>7</sub> CH = CH (CH<sub>2</sub>)<sub>7</sub> CH<sub>3</sub> を表わし、R<sub>1</sub> は下記 (a) ~ (e) で定義される置換基のいずれかである (ここで、Y は 5 ~ 17 のいずれかの整数である)。

- (a) -CH<sub>2</sub> (CH<sub>2</sub>)<sub>Y</sub> CH<sub>3</sub>
- (b) -CH (OH) (CH<sub>2</sub>)<sub>Y</sub> CH<sub>3</sub>
- (c) -CH (OH) (CH<sub>2</sub>)<sub>Y</sub> CH (CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>
- (d) -CH = CH (CH<sub>2</sub>)<sub>Y</sub> CH<sub>3</sub>
- (e) -CH (OH) (CH<sub>2</sub>)<sub>Y</sub> CH (CH<sub>3</sub>) CH<sub>2</sub> CH<sub>3</sub>



本発明はまた、上記の化合物の1種または2種以上を有効成分として含む抗腫瘍剤および免疫賦活剤に関する。

更に、本発明は海綿動物アゲラス・マウリティアヌスから特定のスフィンゴ糖脂質を採取することを特徴とするスフィンゴ糖脂質の製造方法にも関する。